



ANTIHISTAMINIQUES H1

Médicaments antihistaminiques H₁

Les antihistaminiques H₁ sont utilisés depuis plus de 50 ans dans le traitement de diverses manifestations d'origine allergique.

Ce sont des inhibiteurs des récepteurs de l'histamine situés sur la membrane cellulaire.

L'HISTAMINE

L'histamine est un médiateur qui intervient dans:

- la sécrétion gastrique**
- la régulation de la vigilance**
- Certaines manifestations allergiques**

Allergie aux acariens



Allergie alimentaire



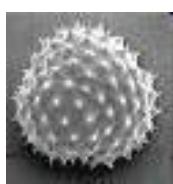
Allergie au venin d'insectes





Bordas

Allergie au pollen



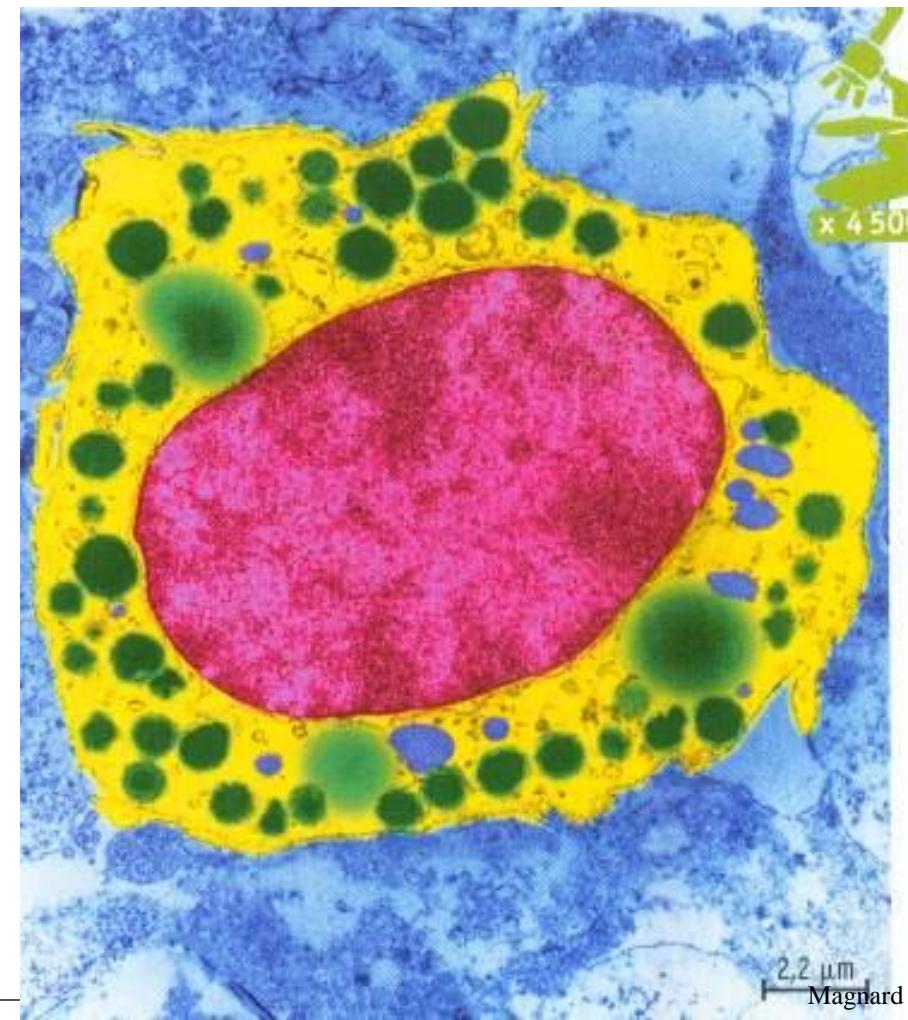
Problème :

Quelles sont les cellules responsables de la réaction allergique ?

Les mastocytes sont des leucocytes présents dans la peau et les muqueuses.

Leur rôle est d'activer les défenses immunitaires en déversant des molécules dans les tissus. Ces molécules sont contenues dans des « granules » ici en vert.

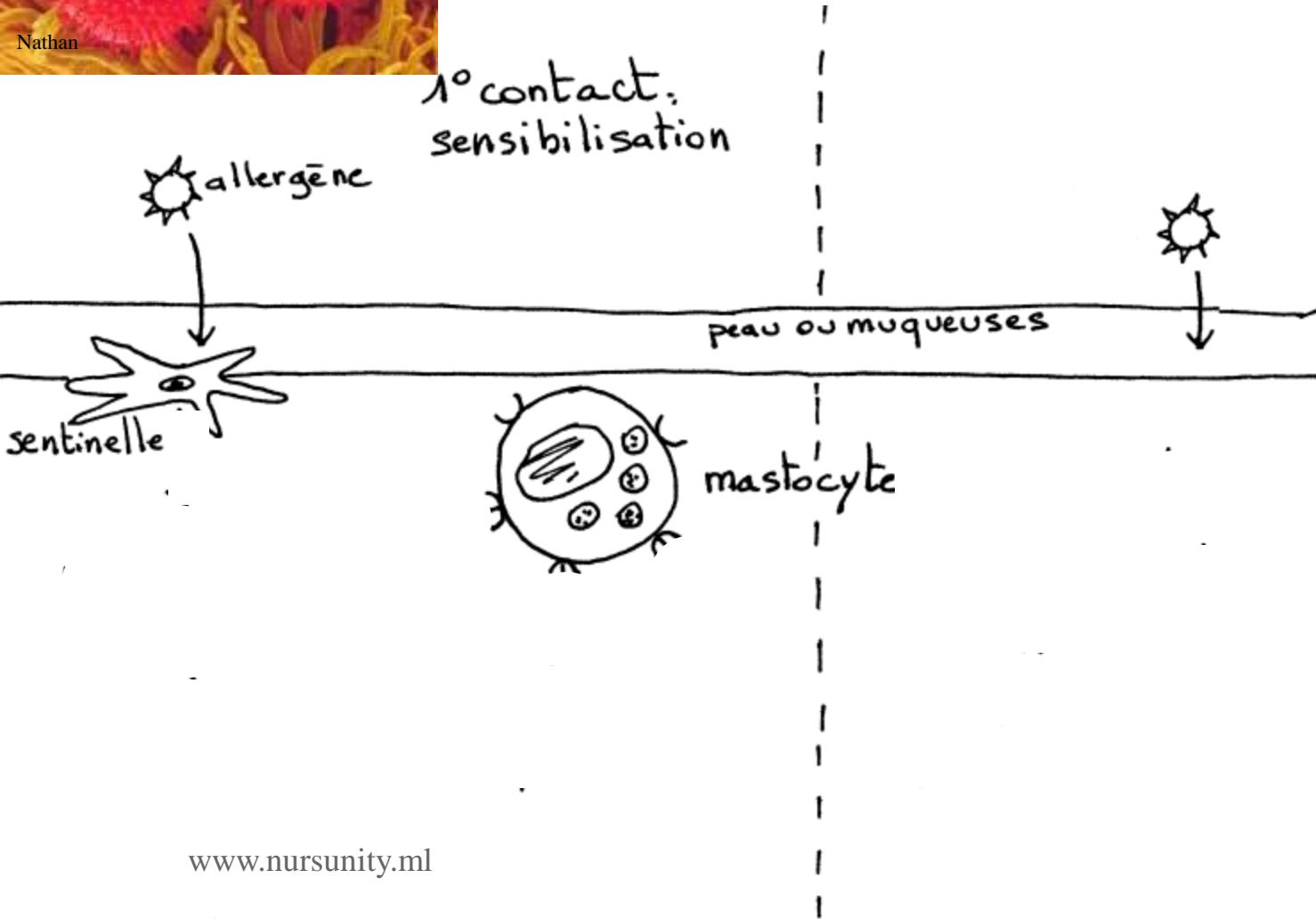
Les mastocytes deviennent fonctionnels quand des anticorps spécifiques se fixent sur des récepteurs présents à leur surface.



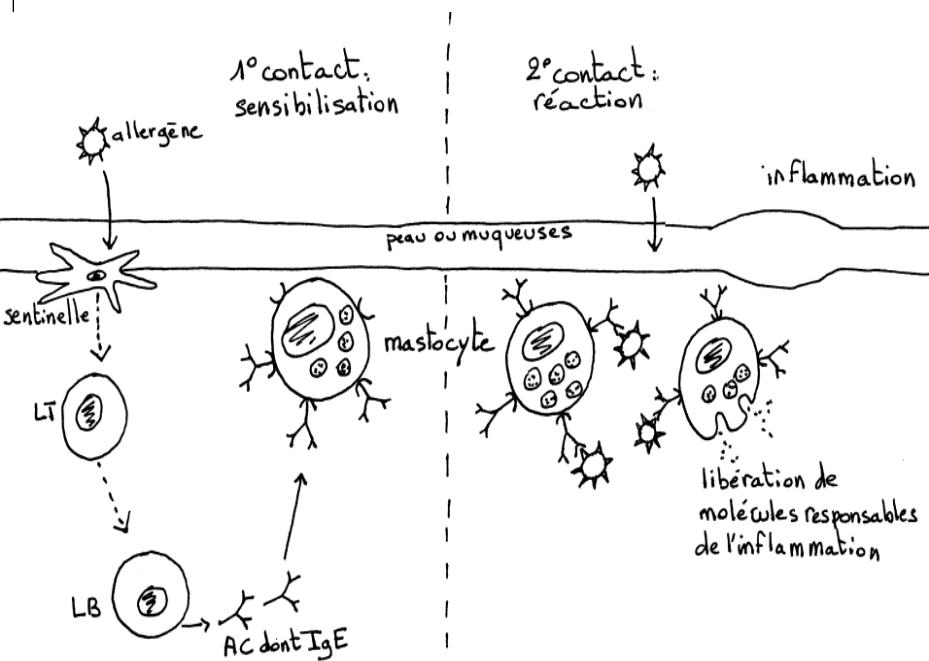
Les différentes étapes de l'allergie :



Nathan



Décrivez les différentes étapes de l'allergie :

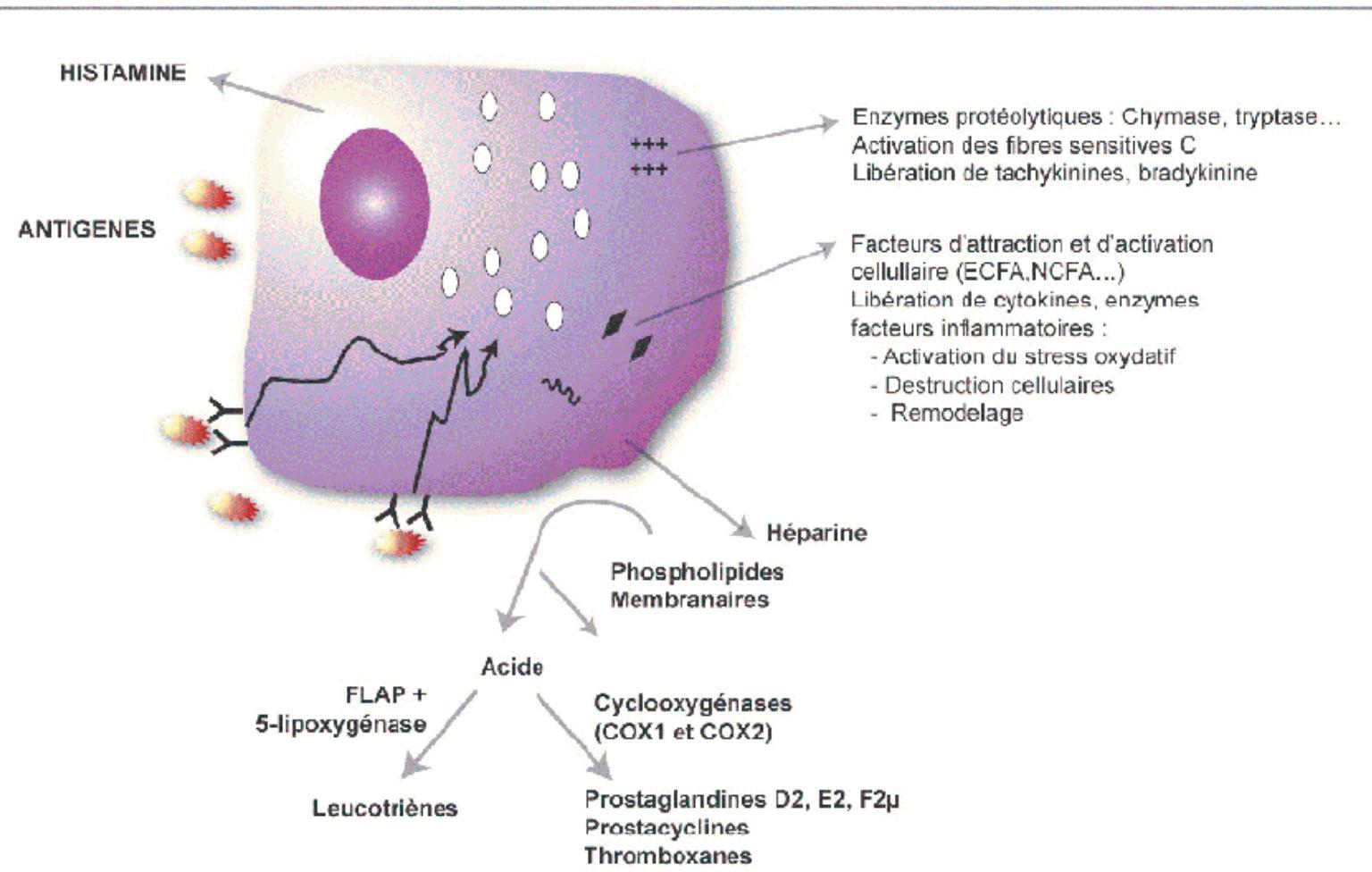


Au 1^o contact avec l'allergène les lymphocytes B fabriquent des anticorps qui se fixent sur des mastocytes.

Au 2^o contact avec l'allergène, les mastocytes libèrent leur contenu et provoquent l'inflammation.

Remarque : parmi les molécules responsables de l'inflammation il y a l'histamine. C'est pour cela que les médicaments à prendre en cas d'allergie contiennent des antihistaminiques.

Substances co-libérées avec l'histamine lors de la dégranulation du mastocyte



Effets et récepteurs

2 types de récepteurs histaminiques:

- Postsynaptiques: H₁ et H₂
- Présynaptiques: H₃ présents dans le cerveau et des récepteurs H₄ décrits plus récemment.

Effets H₁:

- a) Contraction des fibres lisses (bronchiques et digestives)
- b) une vasodilatation capillaire, par libération de monoxyde d'azote.
- c) une augmentation de la vigilance, par effet central
- d) Ralentissement de la conduction auriculo-ventriculaire

Classement

En fonction de **leur ancienneté et de leur effet sur la vigilance**:

- les sédatifs (anciens),
- Les non sédatifs (les nouveaux)

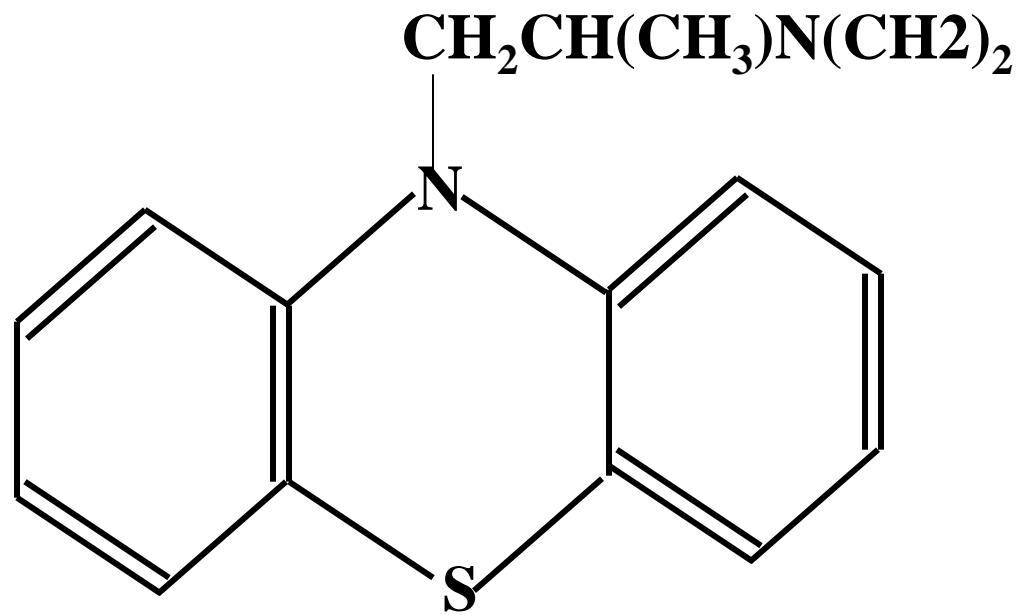
Soit en fonction de l'existence ou non d'un effet parallèle

Antihistaminiques sédatifs et anticholinergiques

- Mépyramine
- Dexchlorphéniramine (Polaramine®)
- Prométhazine (Phénergan®)
- Kétotifène (Zaditen®)

Antihistaminiques non sédatifs et non anticholinergiques

- Astémizole (Hismanal®)
- Cétirizine (Zyrtec, Virlix®)
- Lévocétirizine (Xyzall®)
- Loratadine (Clarytine®)
- Desloratadine (Clarinex®, Aerius®)
- Fexofénadine (Telfast®)
- Mizolastine (Mizollen®)



Prométhazine = PHENERGAN

Effets des antiH1

1. Inhibe les effets H1 de l'histamine.
2. Inhibe les effets vasodilatateurs et l'augmentation de la perméabilité capillaire à l'origine des réactions œdémateuses.
3. Ils ne s'opposent pas aux réactions antigène/anticorps, ni à la libération d'histamine.
4. Absence d'action sur la sécrétion d'acide gastrique.
5. Actions complémentaires: sur le SNC = sédation et stimulation suivant les sujets et les doses.

Utilisation thérapeutique

- Traitement symptomatique de diverses manifestations allergiques cutanées (urticaire) ou muqueuses (rhinite, rhume des foins, conjonctivite).
- Antitussifs anti-histaminiques:
 - alimémazine THERALENE®**
 - oxomémazine TOPLEXIL®**
- Insomnies occasionnelles :**prométhazine**
- Manifestations mineures de l'anxiété. **Hydroxyzine (ATARAX®)**
- Peu efficace dans l'asthme.
- Insuffisants à eux seuls pour traiter un choc anaphylactique ou un œdème du larynx, ils pourraient les prévenir.
- Prescrit avant une anesthésie générale: prévention du bronchospasme
- Migraines allergiques, intolérances alimentaires etc....

Antihistaminiques H1 à usage local

Utilisés sous forme de collyre , solutions nasales ou crème

Collyres: l'azélastine: ALERDUAL*

Solution nasale: l'azélastine: ALLERGODIL*

Préparation dermatologique: Prométhazine: PHENERGAN*

Effets indésirables

➤ sédation et somnolence,

➤ Manifestations neuro-psychiques:

lassitude, incoordination motrice, acouphènes, nervosité, agitation tremblements, euphorie.

➤ Effets parasympatholytiques (anticholinergiques):

sécheresse buccale, constipation, troubles de l'accommodation, rétention urinaire, tachycardie...)

➤ Effets Digestifs:

nausée, vomissements, anorexie.

➤ Accidents sanguins:

leucopénie, anémie hémolytique.

➤ Troubles du rythme cardiaque

➤ Origine de phénomène de sensibilisation: surtout dans le cas de préparation cutanées.

CONTRE INDICATION

Hypersensibilité aux antihistaminiques.

Antécédents d'agranulocytose(prometazine).

Chez la femme enceinte: risque d'effets tératogènes

- Nourrisson de moins de 6 mois,
- Allaitement

•Antih1 anticolinergiques:

- Glaucome angle fermé,
- Rétention urinaire,
- Insuffisance respiratoire

INTERACTION MEDICAMENTEUSE

Association médicamenteuses à éviter

association avec alcool,

Sultopride:risque majoré de troubles du rythme ventriculaire(prometazine)

A prendre en compte :

- Autres dépresseurs du système nerveux central
- Atropine et autres substances atropiniques